FÁRMACOS ANTICOLINÉRGICOS O ANTAGONISTAS MUSCARÍNICOS

María E. Quintanilla Medicina 2011
Prof. Programa Farmacología Molecular y Clínica

Inhiben las acciones muscarínicas de la acetilcolina

Inhiben la Función del parasimpático

Clasificación de los anticolinérgicos

1.- Alcaloides Naturales

Atropina →

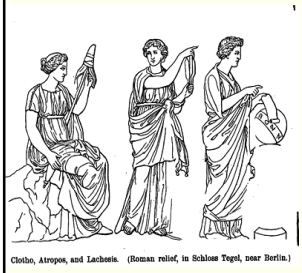
Atropa Belladonna

Escopolamina →

Hyosciamus Nigers

2.- Anticolinérgicos Sintéticos

Atropina (Fármaco tipo)



Clotho, Atropos, and Lachesis. (Roman relief, in Schloss Tegel, near Berlin.)

Farmacocinética

- Buena absorción todas las vías.
- Cruza al SNC
- t½ 2.5 – 4 hrs
- 50% unión pp
- Eliminación por biotrans-formación y excreción

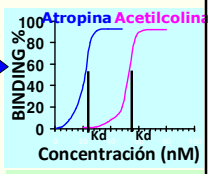
Atropina

¿ Cual es su mecanismo de acción?

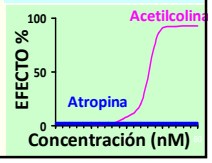
Atropina bloquea receptores muscarínicos
Mecanismo: antagonismo competitivo superable

Características farmacodinámicas de atropina

1. Tiene mayor afinidad que acetilcolina por r. muscarínicos →

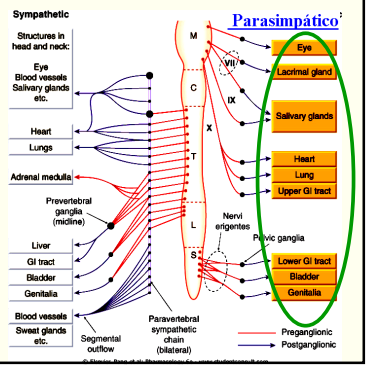


2. No tiene actividad intrínseca. α igual cero →



Atropina bloquea solo los receptores muscarínicos, no los nicotínicos.

Atropina bloquea todos los subtipos de receptores muscarínicos



Atropina

¿ Cuales son sus acciones farmacológicas?

1. SNC

A dosis terapéutica

Atropina → Muy leve estimulación

Escopolamina → Sedación (somnolencia amnesia)

Uso clínico escopolamina: Cinetosis

Dosis tóxicas (intoxicación atropínica)

Excitación, depresión, coma

2. OJO

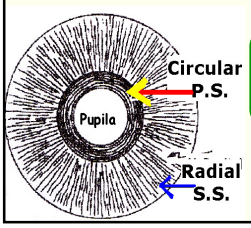
1.- Midriasis (relajan músculo circular) → Fotofobia

Uso clínico: exámen fondo ojos

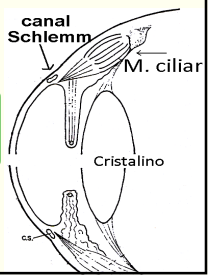
2.-↑ Presión ocular pacientes con glaucoma o predisposición

Contraindicados en el glaucoma

3.- Cicloplejia (parálisis acomodación)



Midriasis y cicloplejia de atropina dura ~ 7 días



3.-Sistema Cardiovascular

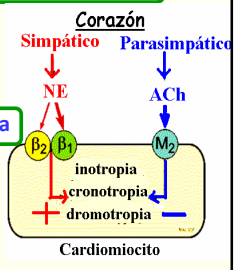
1. Corazón

Taquicardia

Uso clínico: premedicación anestésica

2. Vasos sanguíneos

A dosis terapéutica acción escasa



Dosis tóxicas (intoxicación atropínica)

Arritmia

Rubor atropínico

4.- Sistema urinario

↓ tono y la contracción músculo detrusor de la vejiga

↓ tono y la motilidad de los ureteres

Contraindicados en cuadros de retención urinaria
Ejm: hipertrofia prostática

Uso clínico: alivio del dolor cólico renal (F. 2ª línea)

Dosis tóxicas (intoxicación atropínica)

Globo vesical

5. Glándulas sudoríparas

Inhibe la sudoración

Dosis tóxicas (intoxicación atropínica en niños)
Fiebre atropínica (42ºC)

6.- Aparato digestivo

1.- ↓ tono y peristaltismo gastrointestinal

Uso clínico: antiespasmódico en cólico intestinal

2.- ↓ tono vesícula biliar

Uso clínico: antiespasmódico en cólico biliar

3.- ↓ secreción gástrica ácida

Uso clínico: Anticolinérgicos fueron los primeros usados en úlcera péptica. Hoy no se usan por RAM

↓ Secreción salival, sudor
midriasis
taquicardia
constipación
↓ Secreción gástrica

6.- Aparato digestivo

4.- Xerostomia

Dosis tóxicas (intoxicación atropínica)
Constipación

7. Bronquio

Broncodilatación. Útiles para asma y bronquitis

Inconvenientes del uso de anticolinérgicos como broncodilatadores:
1.-Inhiben movimiento ciliar del epitelio bronquial
2.-Producen boca seca, constipación, taquicardia (por su acción anticolinérgica en otros órganos)

Uso clínico: Hay anticol sintéticos usado en asma y bronquitis

Inhiben secreción nasal faríngea y bronquial

Uso clínico anticolinérgicos: premedicación anestésica para impedir laringoespasmo

Usos clínicos de Atropina

1.- Antiespasmódico

2.- Exámenes oftalmológicos

3.- Premedicación anestésica
- evita bradicardia refleja
- evita ↑ secreciones

4.- Intoxicación con organofosforados u hongos que contienen muscarina.

Anticolinérgicos sintéticos de uso específico en oftalmología

F-F Colirios	*Midriasis y cicloplejia más corta que atropina*
Ciclopentolato	1 día
Tropicamida	6 horas

Uso clínico: exámenes oftalmológicos

Anticolinérgicos sintéticos de uso específico por vía inhalatoria como broncodilatadores

F-F

Aerosol y solución para nebulización

Bromuro Ipratropio

Ventajas

- Acción selectiva bronquio (no se absorbe, posee carga)
- Mínimos efectos secundarios. Casi no llega a otros órganos
- No inhibe limpieza mucociliar

Uso clínico: asma, bronquitis

Anticolinérgicos sintéticos de uso específico como antiespasmódico

Mayor selectividad Musc liso G.I. y urinario

Compuestos amonio cuaternario (con carga)

- **Bromuro de Clidinio(Libraxin®)**
- **Bromuro de Hioscina (Baralgina®)**

Debido a su absorción oral reducida, por lo que concentran su acción a nivel enteral

Aminas terciarias (sin carga)

- **Propinoxato (Viadil®)**

Porque acción espasmolítica se debe a: (i) acción anti-colinérgica y (ii) acción relajante directa musc liso

Anticolinérgicos sintéticos de uso específico en úlcera péptica

Pirenzepina

Antagonista selectivo receptores M_1

Inhibe secreción gástrica actuando en receptores M_1 ganglio intramural estómago y glándulas secretoras gástricas